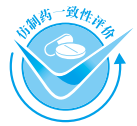


核准日期：2022年11月08日  
修改日期：2023年01月11日  
2023年04月23日  
2024年08月19日



# 依帕司他片说明书

请仔细阅读说明书并在医师或药师指导下使用。

## 【药品名称】

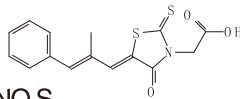
通用名称：依帕司他片  
英文名称：Epalrestat Tablets  
汉语拼音：Yipasita Pian

## 【成份】

本品活性成份为依帕司他。

化学名称：5-[(1Z,2E)-2-甲基-3-苯丙烯叉]-4-氧代-2-硫代-3-噻唑烷乙酸

化学结构式：



分子式：C<sub>15</sub>H<sub>13</sub>NO<sub>3</sub>S<sub>2</sub>

分子量：319.40

辅 料：甘露醇、羟丙纤维素、羧甲纤维素钙、硬脂酸镁和薄膜包衣预混

剂（胃溶型）

## 【性 状】

本品为红色薄膜衣片，除去薄膜衣后显橙黄色。

## 【适 应 症】

糖尿病性神经病变。

## 【规 格】

50mg

## 【用法用量】

通常成人剂量，每次50mg，每日三次，于饭前口服。

## 【不良反应】

文献报道通过临床试验和上市后监测，8498例患者中共有119例(1.4%)，149例不良反应(包括临床实验室检查异常)。其中肝功能异常32例(0.4%)，主要是AST(GOT)、ALT(GPT)升高，腹痛9例(0.1%)，恶心9例(0.1%)，倦怠感6例(0.07%)等。

### 严重不良反应

1. 血小板减少

可能会出现血小板减少（概率不明），若出现应停止用药。

2. 爆发性肝炎、肝功能损害、黄疸、肝功能衰竭

爆发性肝炎（概率不明）、显著AST（GOT）、ALT（GPT）升高等肝功能异常（0.04%）、黄疸（概率不明）、肝功能衰竭（概率不明）等。出现这些不良反应后应立即停止用药。

### 其它不良反应

（1）过敏：偶见红斑、水泡、皮疹、瘙痒。

（2）肝脏：偶见胆红素、AST（GOT）、ALT（GPT）、γ-谷氨酰转移酶（γ-GTP）升高。

（3）消化系统：偶见腹泻、恶心、呕吐、腹痛、食欲不振、腹部胀满感、胃部不适、便秘。

（4）肾脏：偶见肌酐升高，尿量减少、尿频（概率不明）。

（5）血液系统：偶见贫血、白细胞减少。

（6）其他：偶见倦怠感、头晕、头痛、僵硬、乏力、心悸、浮肿、肿痛、四肢痛感、灼热感、麻木、脱毛、紫斑、CK升高、发热等概率不明。

## 【禁 忌】

对本品中任何成份过敏者禁用。

## 【注意事项】

1. 本品应在医生指导下使用，药品应放置在儿童不能接触的地点，防止儿童误食。

2. 本品适合糖化血红蛋白7.0%以上患者使用。

3. 服用本品后，尿液可能出现褐色，因此有些检测项目（如胆红素、酮体）可能会受到影响。

4. 过敏体质者慎用。一旦出现过敏表现，应立即停药，并进行适当处理。

5. 连续服用本品12周无效的患者应考虑改换其他治疗。

### 【孕妇及哺乳期妇女用药】

目前尚无本品用于妊娠期妇女的安全性资料，因此妊娠期妇女使用本品应当极为慎重，只有在获益大于风险时才可应用。动物实验表明依帕司他可通过乳汁分泌，因此哺乳期妇女应避免使用本品。

【儿童用药】本品在儿童的安全有效性尚未建立。

【老年用药】老年患者如有生理机能的改变，使用本品时应考虑适当减量。

【药物相互作用】尚不明确。

【药物过量】尚无本品药物过量的报道。

### 【临床药理】

据文献报道，健康成年人口服本品50mg，1小时后达血药浓度峰值(3.9g/mL)。血浆半衰期为1.8小时，4小时后血药浓度为0.37  $\mu$ g/mL。动物实验证实本品主要分布消化道、肝脏及肾脏，24小时后约有8%从尿中排出，80%左右是从粪便中排出。

### 【药理毒理】

#### 药理作用

依帕司他是一种可逆性的醛糖还原酶非竞争性抑制剂，对醛糖还原酶具有选择性抑制作用。临床研究显示，依帕司他能抑制糖尿病性外周神经病变患者红细胞中山梨醇的积累，与对照组比较能改善患者的自觉症状和神经功能障碍。动物试验结果显示，依帕司他显著抑制糖尿病模型大鼠的坐骨神经、红细胞、视网膜中山梨醇的累积，提高其运动神经传导速度和自主神经机能；在神经形态学上，依帕司他可改善轴突流异常，增加其坐骨神经中有髓神经纤维密度、腓肠神经髓鞘厚度、轴突面积、轴突圆柱率；另外，依帕司他也可改善模型动物坐骨神经的血流并使其肌醇含量回升。

#### 毒理研究

遗传毒性：依帕司他Ames试验、CHL细胞染色体畸变试验、小鼠微核试验结果均为阴性。

生殖毒性：大鼠灌胃给予依帕司他20、100、500mg/kg，生育力与早期胚胎发育毒性试验、胚胎-胎仔发育毒性试验和围产期毒性试验未见异常；兔胚胎-胎仔发育毒性试验中，灌胃给予20、100、250、500mg/kg，可见500mg/kg剂量下流产及胎仔完全吸收的发生率增加。

致癌性：小鼠掺食法给予依帕司他300、800、2000ppm 18个月，大鼠掺食法给予依帕司他500、1500、5000ppm 24个月，未见肿瘤发生率明显增加。

【贮藏】遮光，密封，不超过30℃保存。

【包装】聚氯乙稀固体药用硬片和药用铝箔：10片/板/盒。18片/板/盒。

2x18片/板/盒。

【有效期】24个月

【执行标准】国家药品监督管理局药品注册标准YBH13072022

【批准文号】国药准字H20223840

【上市许可持有人】【生产企业】

企业名称：西安万隆制药股份有限公司

注册地址：西安市高新区新型工业园创新路5号

生产地址：杨凌农业高新技术产业示范区永安路2号

邮政编码：712100

电话：029-85692852 85692858

传真：029-85692860

网址：www.xawanlong.com